

СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ 4,5-ДИГИДРО-1Н-ПИРАЗОЛА НА ОСНОВЕ 3-АЦЕТИЛ-5-НИТРОПИРИДИНОВ

Д. Ф. Вебер¹, А. Л. Олещук², З. Т. Шульгау³, И. В. Кулаков¹

¹Тюменский государственный университет, 625003, Россия, Тюмень, ул. Перекопская, 15а

²Омский государственный университет им. Ф. М. Достоевского,
644077, Россия, Омск, пр. Мира, 55а

³РГП «Национальный центр биотехнологии» КН МОН РК,
Казахстан, 010000, Нур-Султан, шоссе Кургальжинское, 13/5

E-mail: i.v.kulakov@utmn.ru

Халконы представляют значительный интерес для химиков и биохимиков, что обусловлено легкостью их синтеза и высокой фармакологической активностью^{1,2} синтетических и природных халконов. Реакции халконов с бинуклеофилами используют для получения различных гетероциклов, например, 1*H*-пиразолов. Данные соединения являются хорошими люминофорами³, а также обладают широким спектром биологической активности^{4,5}.

В связи с этим для нас представлял интерес синтезировать подобные соединения на примере малоизученных 3-ацетил-5-нитропиридинов **1** и **2**. Конденсацией Кляйзена – Шмидта исходных 3-ацетилпиридинов **1** и **2** с различными альдегидами в спирто-щелочной среде мы получили ряд азахалконов **3(a-l)**. Затем реакцией их гетероциклизации с гидразин-гидратом синтезировали соответствующие 1*H*-пиразолы **4(a-l)** (схема 1).

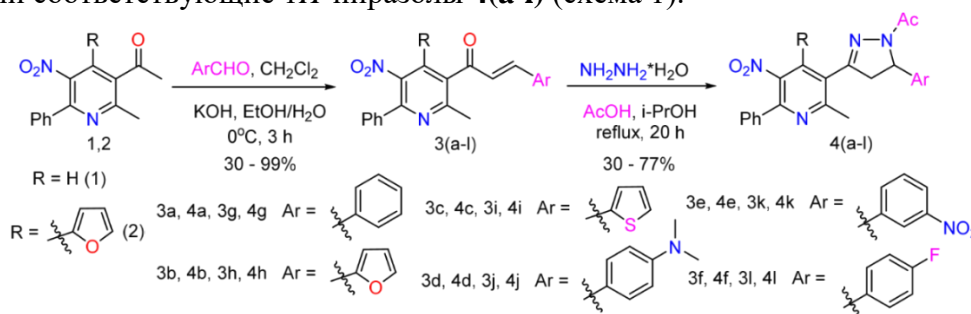


Схема 1. Химические модификации производных 3-ацетил-5-нитропиридинов **1** и **2**

Таким образом, путем химических модификаций производных 3-ацетилпиридина **1,2** получены структуры с новыми фармакофорными группами. Синтезированные соединения **3(a-l)** и **4(a-l)** проявляют умеренную антибактериальную активность *in vitro* по отношению к грамположительным штаммам бактерий *Staphylococcus aureus* и грамотрицательным штаммам бактерий *Escherichia coli*. **4(a-l)** проявляют умеренную антибактериальную активность *in vitro* по отношению к грамположительным штаммам бактерий *Staphylococcus aureus* и грамотрицательным штаммам бактерий *Escherichia coli*.

Библиографический список

1. Umesh C. The role of flavonoids in drug discovery-Review on potential applications / C. V. Umesh, A. M. Jamsheer, P. M. Alex // RJLBPCS. – 2018. – Vol. 4. – Iss. 1. – P. 70-77.
2. Красовицкий Б. М. Препаративная химия органических люминофоров / Б. М. Красовицкий, Л. М. Афанасиади. – Харьков: Фолио, 1997. – С. 117-123.
3. Jamwal A. A review on pyrazole derivatives of pharmacological potential / A. Jamwal, A. Javed, V. Bhardwaj // J. Pharm. BioSci. – 2013. – Vol. 3. – P. 114-123.
4. Synthesis and biological activity of 3, 5-diacetyl-2, 6-dimethylpyridine derivatives / A. L. Oleshchuk, A. A. Karbainova, T. N. Krivoruchko [et al.] // Chemistry of Heterocyclic Compounds. – 2019. – Vol. 55. – Iss. 1. – P. 4751.

Исследование выполнено при финансовой поддержке Комитета науки Министерства образования и науки Республики Казахстан (грант № AP05131602).